

КРАТКА ХАРЕКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. НАИМЕНОВАНИЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

DOLOPROCT rectal cream

ДОЛОПРОКТ ректален крем

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВЕОПАЗВАНЕТО

Приложение към
разрешение за употреба № 11-12186/16.01.06

2. КОЛИЧЕСТВЕН И КАЧЕСТВЕН СЪСТАВ

1 g ректален крем съдържа 1 mg fluocortolone-21-pivalate и 20 mg lidocaine hydrochloride (анхидрид).

За помощни вещества, виж 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Ректален крем (бял крем, непрозрачен).

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Показания

За симптоматично облекчаване на болка, оток, парене, сърбеж, при

- хемороидална болест;
- проктит;
- анална екзема

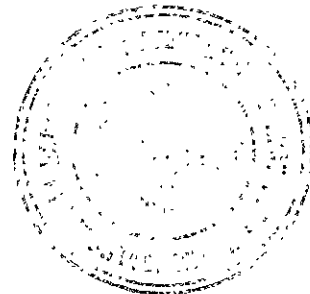
4.2 Дозировка и начин на употреба

Ректалният крем следва да се прилага два пъти дневно, един път сутрин и един път вечер. През първите дни от лечението може да се прилага три пъти дневно. С овладяването на симптоматиката може да бъде достатъчно приложение само веднъж дневно.

Препоръчва се прилагането на Doloproct cream да става след дефекация. Преди употреба аналната област трябва да бъде добре почистена.

Продължителността на лечението не трябва да надвишава 2 седмици.

Нанесете малко крем (колкото грахово зърно) в аналната област с пръст, като с върха на пръста преодолеете съпротивлението на аналния сфинктер.



Ако кремът се прилага в ректума, трябва да се завие приложеният накрайник върху тубата, след което да се постави през ануса. След това може да се приложи малко количество крем в ректума, като леко се стисне тубата.

4.3 Противопоказания

Dolorproct е противопоказан при инфекция на засегнатата област и при положение, че в засегнатата област има симптоми на следните увреждания:

- специфични кожни лезии (сифилис, туберкулоза);
- варицела;
- ваксинни реакции.

Данни за свръхчувствителност към някои от лекарствените вещества или някои от останалите съставки (cetostearyl alcohol).

4.4 Специални противопоказания и специални предупреждения за употреба

Ако Dolorproct rectal cream се прилага в гениталната или аналната области, помощните вещества paraffin и soft paraffin могат да намалят здравината на кондоми от латекс и да нарушат безопасността при употребата им.

Не трябва да се допуска Dolorproct да влиза в контакт в очите. Препоръчва се след употреба ръцете да се измият внимателно.

Лечението при деца и подрастващи не се препоръчва, тъй като не са провеждани клинични проучвания в тези възрастови групи.

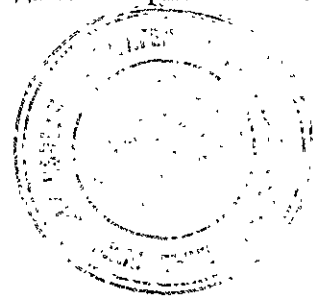
4.5 Лекарствени и други взаимодействия

Lidocaine трябва да се прилага с повишено внимание при пациенти, лекувани с антиаритмични лекарствени продукти.

4.6 Бременност и кърмене

Данните за употребата на Dolorproct cream при бременни са незадоволителни. Експерименталните проучвания върху животни с глюкокортикостероиди показват наличието на репродуктивна токсичност (виж раздел 5.3).

Резултатите от няколко епидемиологични проучвания показват, че може би е налице повишен риск от орални цепки при новородени от жени, провеждали системно лечение с глюкокортикостероиди през първия триместър на бременността. Оралните цепки са рядко срещано заболяване и при положение, че системното приложение на глюкокортикостероиди има тератогенен ефект, това може да стане причина за появата на



не повече от един или два случая на 1 000 жени, лекувани по време на бременността.

Данните от локалното приложение на глюкокортикостероиди по време на бременност са недостатъчни, но в същото време може да се очаква малък риск, тъй като системната наличност на локално прилагани глюкокортикостероиди е много ниска. Като правило продукти, съдържащи глюкокортикостероиди, не следва да се прилагат локално през първия триместър на бременността.

Клиничното показание за лечение с Doloprost трябва да бъде внимателно преценено и ползата да бъде съпоставена с рисковете при бременни или кърмещи жени. Особено следва да се избягва продължителното приложение.

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Doloprost не влияе върху способността за шофиране.

4.8 Нежелани реакции

Честотата на нежеланите реакции е изчислена на базата на обобщени данни от клинични проучвания с 661 пациента. Нежеланите реакции касаят само местни кожни нарушения в ананалната област, като паренето се определя за често срещана нежелана реакция ($\geq 1\%$, $< 10\%$), а дразненето и алергичните реакции са не чести ($\geq 1\%$, $< 1\%$).

След продължително лечение с Doloprost (повече от четири седмици), съществува риск за пациента да развие локални кожни промени като атрофия, стрии или телеангиектазии.

4.9 Предозиране

Според резултатите от проучванията върху остра токсичност на лекарствените вещества, съдържащи се в Doloprost, не може да се очаква наличие на риск от остро отравяне след еднократно ректално или перианално приложение на Doloprost, дори в случай на предозиране по невнимание.

Ако по невнимание продуктът се приеме орално (например при поглъщане на няколко грама крем), основните ефекти, които могат да бъдат очаквани, са системните ефекти на lidocaine hydrochloride, като проявата им в зависимост от погълнатата доза може да бъде тежка сърдечно-съдова (от подтискане до преустановяване на сърдечната дейност) и ЦНС симптоматика (конвулсии, диспнея или дихателна недостатъчност в екстремни случаи).

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1 Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: локален антихемороиден продукт.

АТС код: C05 AX 03



Doloproct не може да премахне причината за развитие на хемороидална болест, проктит и анална екзема

Ако хемороидалната болест е съпроводена с възпаление и екзематозна кожна симптоматика, може да се препоръча комбинирано приложение на Doloproct rectal cream и Doloproct suppositories.

- Fluocortolone-21-pivalate

Fluocortolone-21-pivalate подтиска възпалителните и алергични кожни реакции и облекчава субективните оплаквания като сърбеж, смъдене и болка. Също така редуцира дилатацията на капилярите, отока в интерстициума и инфилтрирането на тъканите. Подтиска капилярното мултиплициране.

- Lidocaine hydrochloride

Lidocaine hydrochloride е стандартен локален анестетик, който се използва от много години. Тъй като има аналгетичен и антипрурисен ефект, установено е че може да се използва ефикасно в супозитории и кремове за лечение на хемороидни оплаквания. Подтискането на болката и сърбежа е в резултат от инхибиране на аферентните нервни влакна.

5.2 Фармакокинетични свойства

След ректално приложение на крема при здрави мъже доброволци, приблизително 15 % от дозата Fluocortolone-21-pivalate и 30 % от дозата Lidocaine hydrochloride са открити в системното кръвообращение (радиомакирани лекарствени вещества).

5.3 Предклинични данни за безопасност

Остра токсичност

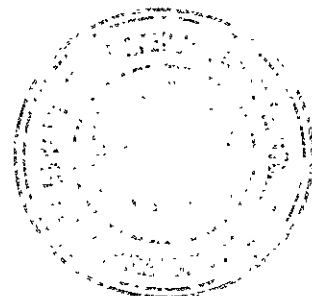
Според резултатите от конвенционалните проучвания за остра токсичност не следва да се очаква специфичен риск при хора в условията на терапевтично приложение.

Подостра/хронична токсичност

За да се оцени системната поносимост след многократно приложение на лекарствените вещества, са проведени проучвания върху токсичността при дермално и ректално приложение. Основните ефекти са тези на типични прояви на предозиране на глюкокортикостероиди или локални анестетици.

Получените резултати относно абсорбцията и бионаличността на двете лекарствени вещества показват обаче, че не може да се очаква фармакодинамично ефикасно системно натоварване, ако Doloproct се прилага съгласно предписанията.

Репродуктивна токсичност



Според проучванията върху ембриотоксичността с fluocortolone/fluocortolone hexanoate и lidocaine hydrochloride, не може да се очаква появата на ембриотоксични/тератогенни ефекти при хора, използващи Doloproct.

Има съмнения от отделни проучвания с животни, че системното приложение на глюкокортикостероиди по време на бременност може да доведе до постнатални ефекти като сърдечносъдови и/или метаболитни заболявания, както и до постоянни промени в плътността на глюкокортикоидните рецептори, в невротрансмитерния обмен и поведението на новороденото.

В същото време глюкокортикостероидите причиняват ембриотоксични и тератогенни ефекти (напр. орална цепка, скелетни малформации, забавяне на интраутеринното развитие, ембриолеталитет) в съответните системи на изследване. Предвид тези резултати следва да се подхожда особено внимателно при предписване на Doloproct по време на бременност. Резултатите от епидемиологичните проучвания са обобщени в раздел 4.6.

Генотоксичност и карценогенност

Проучванията *in-vitro* и *in-vivo* не дават значителни индикации за генотоксичен потенциал на fluocortolone.

Проучвания за специфична туморогенност при fluocortolone/fluocortolone pivalate не са провеждани. Няма съмнение по отношение туморогенния рисков потенциал, съпровождащ терапевтичното приложение на fluocortolone, което е констатирано на базата на фамракодинамичния модел на действие, липсата на доказателства за генотоксичен потенциал, химическата структура и резултатите от проучванията върху хроничната токсичност.

Понастоящем няма предположения, че lidocaine може да бъде мутагенен. Същевременно има данни, че метаболитът на lidocaine – 2,6-xylidine, който се открива при плъхове, а вероятно и при хора, може да притежава мутагенен ефект. Тези индикации се основават на проучванията *in vitro*, при които въпросният метаболит се прилага в много високи, почти токсични концентрации.

При проучвания върху канцерогенността при плъхове с трансплацентарно въздействие и продължило 2 години след раждането третиране с високи дози 2,6-xylidine, се наблюдават едновременно злокачествени и доброкачествени тумори, особено в носната кухина (етмотурбинални). Макар че е малко вероятно този резултат да има отношение към хората, lidocaine не трябва да се прилага във високи дози за продължителен период от време.

Локална поносимост

Проучванията на локалната поносимост на кожата и лигавиците не показват никакви промени, различни от известните при локално приложение на глюкокортикоиди.

Експериментални проучвания за установяване на сенсibiliзирания ефект на лекарствените вещества на Doloproct не са правени. Данните от литературата предполагат, че е възможно лекарствените вещества и останалите компоненти на продукта да



причиняват алергични кожни реакции, като тези наблюдавани спорадично при лечение с Doloprost. В същото време се очаква, че Doloprost би провокирал единствено в редки случаи контактни алергични реакции.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Списък на помощните вещества

Polysorbate 60

Sorbitan stearate

Cetostearyl alcohol

Liquid paraffin

White soft paraffin

Disodium edentate

Sodium dihydrogen phosphate dihydrate

Disodium phosphate dodecahydrate

Benzyl alcohol (E321)

Purified water

6.2 Несъвместимости

Не е приложимо.

6.3 Срок на годност

3 години

6.4 Специални условия за съхранение

Няма.

6.5 Данни за опаковката

Алуминиеви туби, покрити с лаково покритие, с полиетиленова капачка и полипропиленов апликационен накрайник.

10 g, 15 g, 30 g или 50 g.



6.6 Препоръки при употреба/боравене

Да се съхранява на недостъпно за деца място.

7. ИМЕ И АДРЕС НА ПРИТЕЖАТЕЛЯ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Schering AG

Muellerstrasse 170-178,

D-13342 Berlin, Germany

8 ПРОИЗВОДИТЕЛ

Schering S.p.A.

Via E. Schering 21,

I-20090 Segrate (Milan), Italy

9. ДАТА НА ПОСЛЕДНА РЕДАКЦИЯ НА ТЕКСТА

Ноември 2003 г.

